



RYRAZOLYL PYRIMIDINE DERIVATIVE* AND AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL FUNGICIDES

Publication number:	JP54115384 (A)	Also published as:
Publication date:	1979-09-07	 JP57051835 (B)
Inventor(s):	NISHIMURA TAMIO, MIYAMOTO YOSHIKO, OOYAMA HIROSHI, YAMAMURA HIROSHI, MORITA TAKESHI, MATSUMOTO KUNIO, WATANABE TETSUO	 JP1159074 (C)
Applicant(s):	HOKKO CHEM IND CO; MEIJI SEIKA CO	
Classification:		
- international:	A01N43/54; A01N43/56; C07D403/04; C07D403/14; C07D405/14; A01N43/48; C07D403/00; C07D405/00; (IPC1-7): A01N9/22; C07D403/04	
- European:		
Application number:	JP19780023413 19780228	
Priority number(s):	JP19780023413 19780228	

Abstract of JP 54115384 (A)

NEW MATERIAL: A pyrazolylpyrimidine derivative of formula I. [R1 is H, alkyl, or phenyl group; R2 is H, alkyl, or aralkyl group; R3 is halogen, 1-imidazole group, XR4 (X is O, S, or-NH-; R4 is H, alkyl group, etc. when X is O or S; H, amino group, an etc. when X is-NH-); however, R3 is not Cl, SH, etc. when R1 is methyl or phenyl group and R2 is H. USE: Agricultural and horticultural fungicides, particularly active against blast and Helminthosporium leaf spot of rice plants without damaging useful plants, and nontoxic to men and cattle, and fishes. PROCESS: A compound of formula II is chlorinated to give a substance of formula III, which is dissolved in ethanol, saturated with NH3, and heated at 35 deg.C in a sealed tube to afford the compound of formula IV.

Data supplied from the [espacenet](http://www.espacenet.com) database — Worldwide

⑫Int. Cl. ²	識別記号	⑬日本分類	庁内整理番号	⑭公開	昭和54年(1979)9月7日
C 07 D 403/04		16 B 461	6670—4C		
A 01 N 9/22 #		30 F 371.222	7142—4H	発明の数	2
(C 07 D 403/04		30 F 91		審査請求	未請求
C 07 D 233/00			7306—4C		
C 07 D 239/00)			6670—4C		(全 22 頁)

⑮ピラゾリルピリミジン誘導体および農薬芸用殺菌剤

茅ヶ崎市境348番地B—22—19

⑯発明者

山村宏志

秦野市下大槻410番地 下大槻
団地 2—10—304

⑰特 願 昭53—23413

同

森田健

⑱出 願 昭53(1978)2月28日

⑲発 明 者 西村民男

東京都板橋区水川町23の1の40
1

⑳出 願 人

北興化学工業株式会社
東京都中央区日本橋本石町4丁
目2番地

同 宮本美子

㉑代 理 人

弁理士 山下白

川崎市高津区鷺沼1の22の3

鷺沼ビルズ106

同 大山広志

最終頁に続く

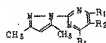
明 細 書

1.発明の名称 ピラゾリルピリミジン誘導体および農



薬芸用殺菌剤

2.特許請求の範囲

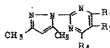
(1) 一般式



【式中、R₁は水素原子、アルキル基またはフェニル基を示し、R₂は水素原子、アルキル基またはアルキル基を示し、R₃はハロゲン原子、1-イミダゾイル基またはX R₄基【ここでXは酸素原子、硫黄原子または-NH-基を示し、Xが酸素原子または硫黄原子を示す場合はR₄は水素原子、アルキル基、アルケニル基、低級アルキル-BO₂-基、シクロアルキル基、アシル基、アルアルキル基、アルフリルアルキル基、フェニル基置換フェニル基または置

換アルキル基を示し、Xが-NH-基を示す場合にはR₄は水素原子、アミノ基、-N=C(R₆)₂基【式中R₅およびR₆は同一または相異つてもよく水素原子、低級アルキル基、フェニル基またはハロゲン置換フェニル基である】またはNHCO R₇基【式中R₇は低級アルキル基またはハロゲン置換低級アルキル基である】を示すが、ただしR₁がメチル基またはフェニル基を示し且つR₂が水素原子を示す場合においてR₃が塩素原子、SH基、O-基、O--CH₃基またはNHNH₂基を示す化合物を除く】で表わされるピラゾリルピリミジン誘導体。

(2) 一般式



【式中、R₁は水素原子、アルキル基またはフェニル基を示し、R₂は水素原子、アルキル基

またはアルキル基を示し、 R_3 はハロゲン原子、1-イミダゾイル基または XR_4 基〔ここで X は酸素原子、硫黄原子または $-NH-$ 基を示し、 X が酸素原子または硫黄原子を示す場合は R_4 は水素原子、アルキル基、アルケニル基、低級アルキル- BO_2- 基、シクロアルキル基、アシル基、アルアルキル基、フルリルアルキル基、フェニル基、置換フェニル基または置換アルキル基を示し、 X が $-NH-$ 基を示す場合には R_4 は水素原子、アミノ基、 $-S-C(R_5)(R_6)-$ 基〔式中 R_5 および R_6 は同一または相異つてもよく水素原子、低級アルキル基、フェニル基またはハロゲン置換フェニル基である〕または $NHCO R_7$ 基〔式中 R_7 は低級アルキルまたはハロゲン置換低級アルキル基である〕〕を示すが、ただし R_1 がメチル基またはフェニル基を示し且つ R_2 が水素原子を示す場合におい

- 5 -

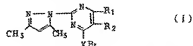
フルリルアルキル基、フェニル基、置換フェニル基または置換アルキル基を示し、 X が $-NH-$ 基を示す場合には R_4 は水素原子、アミノ基、 $-S-C(R_5)(R_6)-$ 基〔式中 R_5 および R_6 は同一または相異つてもよく水素原子、低級アルキル基、フェニル基またはハロゲン置換フェニル基である〕または $NHCO R_7$ 基〔式中 R_7 は低級アルキル基またはハロゲン置換低級アルキル基である〕〕を示すが、ただし R_1 がメチル基またはフェニル基を示し且つ R_2 が水素原子を示す場合において R_3 が塩素原子、 OH 基、 $O-\text{C}_6\text{H}_5$ 基、 $O-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$ 基または $NHNH_2$ 基を示す化合物を除く〕で表わされる新規なピラゾリルビリミジン誘導体およびそれを含有する農薬用殺菌剤に関する。

前記一般式(1)に類似する化合物としては2-(3,5-ジメチル-1-ピラゾリル)-4-メチル-6-ヒドロキシビリミジン、2-(3,5-

て R_3 が塩素原子、 OH 基、 $O-\text{C}_6\text{H}_5$ 基、 $O-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Cl}$ 基または $NHNH_2$ 基を示す化合物を除く〕で表わされるピラゾリルビリミジン誘導体を有効成分として含有することを特徴とする農薬用殺菌剤。

▲発明の詳細な説明

本発明は、一般式(1)



(1)

〔式中、 R_1 は水素原子、アルキル基またはフェニル基を示し、 R_2 は水素原子、アルキル基またはアルアルキル基を示し、 R_3 はハロゲン原子、1-イミダゾイル基または XR_4 基〔ここで X は酸素原子、硫黄原子または $-NH-$ 基を示し、 X が酸素原子または硫黄原子を示す場合は R_4 は水素原子、アルキル基、アルケニル基、低級アルキル- BO_2- 基、シクロアルキル基、アシル基、アルアルキル基、

- 6 -

-ジメチル-1-ピラゾリル)-4-フェニル-6-ヒドロキシビリミジンおよび2-(3,5-ジメチル-1-ピラゾリル)-4-メチル-6-チオシアノビリミジンが武田研究所年報第24巻第250~258頁(1965)において種々のいもち病に防除活性を有する反面強い被害を与えることが知られている。

本発明者等は一連のピラゾリルビリミジン系化合物を多数合成して農薬用殺菌剤としての実用性について鋭意検討した。その結果、前記一般式(1)で表わされる化合物群が新規化合物であり、且つ農薬用殺菌剤として特に種々のいもち病、ごま葉枯病、ヤエウリのうどんこ病などに対して極めて顕著な防除活性を有することを見出した。

これら一連の化合物は強力な殺菌作用を有するが有用植物には全く被害を与えることなく、

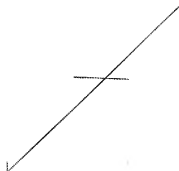
- 6 -

また人畜毒性や魚毒性もなく安全に使用できる。

極めて優れた殺菌剤である。

本発明のこのように特徴は前記文献に記載された技術レベルからは当業者といえども推考しがたいものであり、本発明に係る新規化合物は汎用性の農薬用殺菌剤としてその実用性が大いに期待される。

前記一般式(I)の化合物は次式の方法により容易に製造することができる。

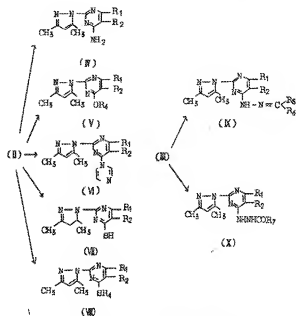
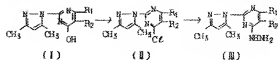


— 7 —

これら(I)~(II)で示される化合物類を製造する方法を簡単に説明する。まず(I)式の化合物は薬学雑誌第96巻第384~387頁(1976)に記載された方法により、対応する2-ヒドラジノ体をエタノールまたはメタノール中でアセトンと加熱することにより得ることができる。また(II)式の化合物は特公昭39-4493号公報に記載の方法により、対応する6-ヒドロキシ体(II)をオキシ塩化リンと加熱することにより得ることができる。また(III)式の化合物は特公昭39-4491号公報に記載の方法により、対応する6-クロル体(III)をエタノール中でヒドラジンヒドレートと加熱することにより得ることができる。また(IV)式化合物は対応する6-クロル体(IV)をエタノールに溶解した後、アンモニアを飽和し、封管中35℃に加熱することにより得られる。また(V)式の化合物は、 R_4 が置換フェニル基であ

— 9 —

反応式



(R_1, R_2, R_3, R_4 および R_5 の定義は前記と同じである)

— 8 —

る場合は対応するフェノール類と(IV)式化合物とを乾燥アセトンまたはメチルエタレトン中で無水炭酸カリの存在下に遊走することにより、また R_4 がアルキル基である場合は対応するアルコール中にナトリウムを溶解し、そして(IV)式化合物を加えて加熱することにより得られる。また(III)式化合物は(IV)式化合物とイミダゾールとをトルエン中で遊走することにより得ることができる。また(II)式の化合物は特公昭39-4492号公報に記載の方法により6-クロル体(II)とチオ尿素とをエタノールまたはブタノール中で加熱することにより得られる。また(III)式の化合物は(IV)式化合物をアルカリの存在下で対応するハロゲン化物とを溶液中で反応することにより得ることができる。また(III)式の化合物は R_5 が低級アルキル基である場合は対応する(IV)式の化合物を塩酸の存在下あるいはこれを加えずしてアセトン中で加熱することにより、また R_5, R_6 がハロゲン置換フェニル

— 10 —

基である場合はエタノール中でハロゲン置換ベンズアルデヒドと加熱することにより得ることができる。また (X) 式の化合物 R_1 が低級アルキル基である場合は (E) 式の化合物を乾燥ピリジンに懸濁し、対応するハロゲン化物で処理することにより、また R_1 がハロゲン置換低級アルキル基である場合は (G) 式化合物 DMF 中でジエタラミンの存在下に対応するハロゲン化物で処理することにより得ることができる。

次にその実施例を若干示すが本発明は以下の実施例のみに限定されるものではない。



-11-

して得られる。

実施例 3 (化合物 182 の製法、開系化合物)

化合物 1 の化合物 1.2 g にイソプロパノール 10 ml および 9.0 g ヒドラジンヒドラート 1 ml を加え、5 分間遊走液冷却すると結晶が析出する。結晶を分別し、エタノール-水 (1:2) 12 ml で再結晶すると融点 187~190℃ 淡黄色結晶 0.89 g (収率 77%) が得られる。

実施例 4 (化合物 171 の製法、開系化合物)

2 - (3,5-ジメチル-1-ピラゾリル) - 6-ヒドラジノ-4-メチルピリミジン 0.5 g にアセトン 10 ml を加え、水中で 1 時間 30 分遊走後、反応液を減圧乾固すると融点 136~138℃ の化合物 171 の化合物 0.57 g (収率 98%) が無色柱状晶として得られる。このものはヘキサンより再結晶して融点 138~139℃ を示した。

-15-

実施例 1 (化合物 16 b の製法、開系化合物)

2-ヒドラジノ-4-フェニル-5-エチル-6-ヒドロキシフェニルピリミジン 1.2 g とアセチルアセトン 0.5 g とをエタノール 20 ml 中で 3 時間遊走後減圧下に溶液を前除去すると化合物 16 b の化合物 1.46 g (収率 99%) が得られる。このものをイソプロパノールから再結晶すると融点 182~183℃ の淡黄色鱗片状晶となる。

実施例 2 (化合物 4 の製法、開系化合物)

化合物 141 の化合物 3.2 g をオキシ塩化リン 15 ml 中で 2 時間遊走後、オキシ塩化リンを減圧下に留去し、残留物に水を加える。結晶を分別し、エタノール-水 (2:1) 6 ml から再結晶すると融点 45~46℃ の化合物 4 の化合物 2.6 g (収率 78%) が淡黄色針状晶と

-12-

実施例 5 (化合物 174 の製法、開系化合物)

2 - (3,5-ジメチル-1-ピラゾリル) - 6-ヒドラジノ-4-メチルピリミジン 0.5 g をエタノール 10 ml に溶解し、4-クロルベンズアルデヒド 0.34 g を加え、水中で 1 時間 30 分間遊走後、反応液を減圧濃縮し、析出した結晶を採取する。このものをメタノール 6 ml より再結晶すると融点 189~190℃ の化合物 174 の化合物 0.43 g (収率 61%) が無色針状晶として得られた。

実施例 6 (化合物 179 の製法、開系化合物)

2 - (3,5-ジメチル-1-ピラゾリル) - 6-ヒドラジノ-4-フェニルピリミジン 0.3 g を乾燥ピリジン 10 ml に懸濁し、塩化トリメチルアセチル 0.16 g を加え、室温で 1 時間攪拌する。反応液を減圧乾固し、水 5 ml を加えて赤褐色の結晶を採取する。メタノールから再結晶

-14-

すると融点19.15~19.25の化合物 Δ 179の化合物0.29g(収率74%)が淡褐色柱状晶として得られた。

実施例7 (化合物 Δ 181の製法、(IX)系化合物)

2-(3,5-ジメチル-1-ピラゾリル)-4-メチル-5- α -ヘキシル-6-ヒドラジノビリミジン0.15gをDMF 2mlに溶解し、ジエチルアミン0.06gを加え、次いで氷冷下に攪拌しながら塩化クロルアセチル0.06gを滴下する。30分間攪拌した後水を加え、析出した固体を採取し、イソプロパノールから再結晶すると化合物 Δ 181の化合物0.15g(収率79%)が白色粉末として得られた。融点は176~179℃であつた。

実施例8 (化合物 Δ 168の製法、(IX)系化合物)

2-(3,5-ジメチル-1-ピラゾリル)-4-フエニル-6-クロルビリミジン2.0gを

-18-

99.5%エタノール16mlから再結晶すると化合物 Δ 97の化合物1.22g(収率70%)が黒色針状晶として得られた。融点は154~158℃であつた。

実施例10 (化合物 Δ 156の製法、(IX)系化合物)

イソプロパノール14mlにナトリウム0.127gを溶解し、この中に2-(3,5-ジメチル-1-ピラゾリル)-4-フエニル-6-クロルビリミジン1.42gを加え、室温で3時間半攪拌する。反応液を2.5%塩酸で中和後、減圧乾固し、水2.0mlを加えて結晶を識別する。ヘキサン28mlから再結晶すると化合物 Δ 156の化合物1.19g(収率77%)が淡紅色柱状晶として得られた。融点は117~118℃であつた。

実施例11 (化合物 Δ 6の製法、(IX)系化合物)

2-(3,5-ジメチル-1-ピラゾリル)-

-17-

99.5%エタノール30mlに溶解し、氷冷下にアンモニアを飽和後封管し、35℃に6日間放置する。反応液を減圧乾固して得られた白色結晶を2.5%塩酸12mlに溶解し、硫酸1.0%水酸化ナトリウム水溶液でpH9に調整する。析出した結晶を採取し、50%エタノールより再結晶すると化合物 Δ 168の化合物1.52g(収率82%)が無色板晶として得られた。融点は172~174℃であつた。

実施例9 (化合物 Δ 97の製法、(IX)系化合物)

2-(3,5-ジメチル-1-ピラゾリル)-4-メチル-6-クロルビリミジン1.1gと3,4-ジクロルフェノール0.90gとを乾燥アセトンに溶解し、無水炭酸カリウム1.58gを加えて46時間加熱還流する。反応液を減圧乾固した後水5.0mlを加え、1.0%水酸化ナトリウムでpH11に調整し、不溶の結晶をろ取水洗後、

-16-

4-フエニル-6-クロルビリミジン2.28gとイミダゾール0.80gとをトルエン32ml中で21時間加熱還流する。反応液を減圧乾固し、残留する褐色あめ状物をクロロホルム40mlに溶解し、水40mlで2回洗う。クロロホルム層を2.5%塩酸3.0mlで抽出し、水層を2.5%水酸化ナトリウム溶液で中和する。析出したあめ状物をエーテルで洗って結晶化させ、メタノール8mlから再結晶すると化合物 Δ 6の化合物1.29g(収率51%)が無色板晶として得られた。融点は178~179℃であつた。

実施例12 (化合物 Δ 145の製法、(IX)系化合物)

化合物 Δ 5の化合物0.36gとチオ尿素0.08gとをn-ブタノール53ml中で5時間加熱還流後、溶液を減圧下に留去する。残留物に1N水酸化ナトリウム水溶液2mlを加え、4時間加熱還流

-18-

する。水20mlを加え酢酸で酸性にした後クロロホルムで抽出し、クロロホルム層を5%炭酸水素ナトリウム水溶液次いで水で洗い無水硫酸ナトリウムで乾燥後溶媒を留去する。残留油状物をイソプロパノールから再結晶すると化合物145の化合物0.26g(収率7.2%)が黄色針状晶として得られた。融点は62~64℃であつた。

実施例13 (化合物157の製法、(Ⅷ)系化合物)

2-(3,5-ジメチル-1-ピラゾリル)-4-フェニル-6-メルカプトピリミジン0.2gをDMF 4mlに溶解し、炭化メチル0.16gおよび10%水酸化ナトリウム水溶液0.44gを加え、室温で3時間攪拌する。反応液に水5mlを加え、エーテルで抽出し、エーテル溶液を乾燥後、あめ状物をベンゼンに溶解し、ヘキサンを加えて

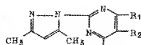
-19-

2-(3,5-ジメチル-1-ピラゾリル)-4-メチル-6-メルカプトピリミジン0.44gおよび塩化4-クロロベンジル0.35gを乾燥アセトン30ml中で無水炭酸カリウム0.3gの存在下に2時間煮沸する。反応液を減圧乾留し、水20mlを加え不溶物を水洗する。9.95%エタノール3mlより再結晶すると化合物42の化合物0.46g(収率6.7%)が無色針状晶として得られた。融点は125~127℃であつた。

このようにして製造された一般式(I)の化合物例を第1表に示す。

なお、化合物番号は以下の試験例および実施例においても参照される。

第1表



-21-

特開昭54-115384(Ⅷ)系化合物157の化合物0.12g(収率5.7%)が得られた。融点は93~95℃であつた。

実施例14 (化合物163の製法、(Ⅷ)系化合物)


2-(3,5-ジメチル-1-ピラゾリル)-4-フェニル-6-メルカプトピリミジン0.5gをDMF 6mlに溶解し、クロロ酢酸エチル0.20gおよび無水炭酸カリウム0.17gを加えて油浴(90~100℃)で3時間加熱する。反応液に水10mlを加えて析出した結晶をろ取し、メタノール2.5mlに溶解した後水0.4mlを加えて結晶を析出させると化合物163の化合物0.25gが淡黄色柱状晶として得られた。融点は106~107℃であつた。

実施例15 (化合物42の製法、(Ⅷ)系化合物)







-20-

化合物 No.	R ₁	R ₂	R ₃		物性値(融点 または溶解性)
			X	Y	
1	CH ₃	CH ₃		Cl	m.p. 89~91
2	CH ₃	C ₆ H ₅ -n		Cl	# 41~43
3	CH ₃	C ₆ H ₄ -n		Cl	# 52~54
4	CH ₃	C ₆ H ₄ -n		Cl	# 45~46
5	CH ₃	C ₁₀ H ₇ -n		Cl	# 59~60
6		H			# 178~179
7	H	H	O	H	# 107~110
8	H	H	S	H	# 159~1405
9	H	H	O	C ₆ H ₅	n _D ²⁰ 15450
10	H	H	S	C ₆ H ₅	m.p. 44~47
11	H	H	O		n _D ²⁰ 15962
12	H	H	S		# 16284
13	CH ₃	H	O	CH ₃	m.p. 69~71
14	CH ₃	H	O	C ₆ H ₅	n _D ²⁰ 15497
15	CH ₃	H	O	C ₆ H ₅ -n	# 15366










-22-

化合物 No.	R ₁	R ₂	R ₃		物性値 (融点 または屈折率)
			X	R ₄	
16	CH ₃	H	O	C ₂ H ₅ -1	n _D ²⁰ 1.5330
17	CH ₃	H	O	C ₂ H ₅ -n	m.p. 45~48
18	CH ₃	H	O	C ₂ H ₅ -1-n	n _D ²⁰ 1.4947
19	CH ₃	H	O	C ₂ H ₅ -3-n	# 1.5225
20	CH ₃	H	O	C ₂ H ₅ -7-n	# 1.4863
21	CH ₃	H	O	C ₁₀ H ₂₁ -n	m.p. 96~98
22	CH ₃	H	O	CH ₂ -CH=CH ₂	n _D ²⁰ 1.5493
23	CH ₃	H	O	CH ₂ -CH=CH-CH ₃	# 1.5246
24	CH ₃	H	O	SO ₂ CH ₃	m.p. 134~136
25	CH ₃	H	O	CH ₂ - 	n _D ²⁰ 1.5696
26	CH ₃	H	S	CH ₃	m.p. 95~96
27	CH ₃	H	S	C ₂ H ₅	n _D ²⁰ 1.5966
28	CH ₃	H	S	C ₂ H ₅ -n	# 1.5871
29	CH ₃	H	S	C ₂ H ₅ -1	# 1.5863
30	CH ₃	H	S	C ₂ H ₅ -n	# 1.5785














- 2 3 -

化合物 No.	R ₁	R ₂	R ₃		物性値 (融点 または屈折率)
			X	R ₄	
31	CH ₃	H	S	C ₄ H ₉ -t	m.p. 102~103
32	CH ₃	H	S	C ₃ H ₇ -n	n _D ²⁰ 1.5717
33	CH ₃	H	S	C ₄ H ₉ -3-n	# 1.5650
34	CH ₃	H	S	C ₈ H ₁₇ -n	# 1.5485
35	CH ₃	H	S	C ₁₀ H ₂₁ -n	# 1.5446
36	CH ₃	H	S	CH ₂ -CH=CH ₂	# 1.6018
37	CH ₃	H	S	CH ₂ -CH=CH-CH ₃	# 1.5969
38	CH ₃	H	S		# 1.5814
39	CH ₃	H	S	OOCH ₃	m.p. 94~96
40	CH ₃	H	S	OO- 	# 85~87
41	CH ₃	H	S	CH ₂ - 	# 81~82
42	CH ₃	H	S	CH ₂ - 	# 125~127
43	CH ₃	H	S	CH ₂ - 	# 106~107
44	CH ₃	H	S	CH ₂ - 	n _D ²⁰ 1.5943
45	CH ₃	H	S	CH ₂ OC ₂ H ₅	# 1.5949

- 2 4 -

化合物 No.	R ₁	R ₂	R ₃		物性値 (融点 または屈折率)
			X	R ₄	
46	CH ₃	H	S	CH ₂ SC ₂ H ₅	n _D ²⁰ 1.6125
47	CH ₃	H	S	CH ₂ CN	m.p. 149~151
48	CH ₃	H	S	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN	n _D ²⁰ 1.5920
49	CH ₃	H	S	CH ₂ COOC ₂ H ₅	m.p. 64~67
50	CH ₃	H	S		# 112~114
51	CH ₃	H	O		# 144.5~145
52	CH ₃	H	O		# 114.5~115
53	CH ₃	H	O		# 162~163
54	CH ₃	H	O		# 107~108
55	CH ₃	H	O		# 158.5~160
56	CH ₃	H	O		# 77~78
57	CH ₃	H	O		# 82.5~83
58	CH ₃	H	O		# 92~93

- 2 5 -

化合物 No.	R ₁	R ₂	R ₃		物性値 (融点 または屈折率)
			X	R ₄	
59	CH ₃	H	O		m.p. 77~78
60	CH ₃	H	O		# 81~82
61	CH ₃	H	O		# 94~95
62	CH ₃	H	O		# 124.5~125
63	CH ₃	H	S		n _D ²⁰ 1.6380
64	CH ₃	H	O		m.p. 48~50
65	CH ₃	H	O		# 103~104
66	CH ₃	H	O		# 128.5~129
67	CH ₃	H	O		# 107.5~108.5
68	CH ₃	H	O		# 78~80
69	CH ₃	H	O		# 91.5~92.5
70	CH ₃	H	O		# 124~125
71	CH ₃	H	O		# 104.5~105.5

- 2 6 -

化合物 No.	R ₁	R ₂	R ₃		物性値 (融点 または屈折率)
			X	R ₄	
72	CH ₃	H	O		n_D^{20} 1.5938
73	CH ₃	H	O		m.p. 197~198
74	CH ₃	H	O		# 173~176
75	CH ₃	H	O		# 173~174
76	CH ₃	H	O		# 146~147
77	CH ₃	H	O		# 149~151
78	CH ₃	H	O		# 166~167
79	CH ₃	H	O		# 175~176
80	CH ₃	H	O		# 220~223
81	CH ₃	H	O		# 117~118
82	CH ₃	H	O		# 159~160
83	CH ₃	H	O		# 206~207
84	CH ₃	H	O		# 247~248

- 27 -

化合物 No.	R ₁	R ₂	X	R ₃		物性値 (融点 または屈折率)
				X	R ₄	
85	CH ₃	H	O			m.p. 127~129
86	CH ₃	H	O			# 231.5~233
87	CH ₃	H	O			# 94~95
88	CH ₃	H	O			# 94.5~95.5
89	CH ₃	H	O			# 109~109.5
90	CH ₃	H	O			# 125.5~126.5
91	CH ₃	H	O			# 233~235
92	CH ₃	H	O			# 206~208
93	CH ₃	H	O			# 199~200
94	CH ₃	H	O			# 103~105
95	CH ₃	H	O			# 117~118
96	CH ₃	H	O			# 199~200








- 28 -

化合物 No.	R ₁	R ₂	R ₃		物性値 (融点 または屈折率)
			X	R ₄	
97	CH ₃	H	O		m.p. 156~157
98	CH ₃	H	O		# 209~210
99	CH ₃	H	O		# 165~166.5
100	CH ₃	H	O		# 123~124
101	CH ₃	H	O		# 158~160
102	CH ₃	H	O		# 194~195
103	CH ₃	H	O		# 182.5~184
104	CH ₃	H	O		# 92.5~93.5
105	CH ₃	H	O		# 88~89
106	CH ₃	H	O		n_D^{20} 1.5821

- 29 -































化合物 No.	R ₁	R ₂	X	R ₃		物性値 (融点 または屈折率)
				X	R ₄	
107	CH ₃	H	O			m.p. 66~67
108	CH ₃	H	O			# 97.5~98
109	CH ₃	H	O			# 99~100
110	CH ₃	H	O			# 75~76.5
111	CH ₃	H	O			# 131~132
112	CH ₃	H	O			# 70~71.5
113	CH ₃	H	O			# 105.5~106.5
114	CH ₃	H	O			# 177~178
115	CH ₃	H	O			# 142~143

- 30 -

化合物 No.	R ₁	R ₂	R ₃		物性値 (融点 または折率)	化合物 No.	R ₁	R ₂	R ₃		物性値 (融点 または折率)
			X	R ₄					X	R ₄	
116	CH ₃	H	O		m.p. 245~246	131	CH ₃	C ₂ H ₅ -n	O	CH ₃	m.p. 62~65
117	H	CH ₃	O	H	# 132~132.5	132	CH ₃	C ₆ H ₅ -n	O	H	# 95~99
118	H	CH ₃	S	H	# 138~142	133	CH ₃	C ₆ H ₅ -n	S	H	# 117~119
119	H	CH ₃	O	C ₂ H ₅	# 78~79	134	CH ₃	C ₆ H ₅ -n	O	C ₂ H ₅	# 111~112.5
120	H	CH ₃	S	C ₂ H ₅	# 58~59	135	CH ₃	C ₆ H ₅ -n	S	C ₂ H ₅	n _D ²⁰ 1.5718
121	H	CH ₃	O		# 117~118.5	136	CH ₃	C ₆ H ₅ -n	O		m.p. 97.5~99.5
122	H	CH ₃	S		# 131~132	137	CH ₃	C ₆ H ₅ -n	S		# 85~88
123	CH ₃	CH ₃	O	H	# 157~158	138	CH ₃	C ₆ H ₅ -n	O	H	# 85~89
124	CH ₃	CH ₃	S	H	# 164~165	139	CH ₃	C ₆ H ₅ -n	S	H	# 107~108.5
125	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	# 90~92	140	CH ₃	C ₆ H ₅ -n	O	CH ₃	# 69~70
126	CH ₃	CH ₃	S	C ₂ H ₅	# 59~61.5	141	CH ₃	C ₆ H ₅ -n	O	H	# 78~80
127	CH ₃	CH ₃	O		n _D ²⁰ 1.6035	142	CH ₃	C ₆ H ₅ -n	S	H	# 72~73
128	CH ₃	CH ₃	S		# 1.6505	143	CH ₃	C ₆ H ₅ -n	O	CH ₃	# 64~66
129	CH ₃	C ₂ H ₅ -n	O	H	m.p. 106~108	144	CH ₃	C ₁₀ H ₂₁ -n	O	H	# 74~78
130	CH ₃	C ₂ H ₅ -n	S	H	# 112~113	145	CH ₃	C ₁₀ H ₂₁ -n	S	H	# 62~64


- 3 1 -

- 3 2 -

化合物 No.	R ₁	R ₂	R ₃		物性値 (融点 または折率)	化合物 No.	R ₁	R ₂	R ₃		物性値 (融点 または折率)
			X	R ₄					X	R ₄	
146	C ₆ H ₅ -n	H	O	H	m.p. 65~66	161		H	O		m.p. 223~224.5
147	C ₆ H ₅ -n	H	S	H	# 244~247	162		H	O		# 187.5
148	C ₆ H ₅ -n	H	O	C ₂ H ₅	n _D ²⁰ 1.5278	163		H	S	CH ₂ COOC ₂ H ₅	# 106~107
149	C ₆ H ₅ -n	H	S	C ₂ H ₅	# 155.49	164	CH ₃		O	H	# 196~197
150	C ₆ H ₅ -n	H	O		# 156.42	165		CH ₃	O	H	# 164~165
151	C ₆ H ₅ -n	H	S		# 162.86	166		C ₂ H ₅	O	H	# 182~183
152	C ₆ H ₅ -n	H	O		m.p. 83~85	167		C ₆ H ₅ -n	O	H	# 107~108
153		H	O	CH ₃	# 114~115	168		H	NH	H	# 171~172
154		H	O	C ₂ H ₅	# 75~77	169	CH ₃	C ₂ H ₅ -n	NH	N=C< 	# 234~236
155		H	O	C ₂ H ₅ -n	# 79.5~80.5	170	CH ₃	C ₆ H ₅ -n	NH	N=C< 	# 212~213
156		H	O	C ₂ H ₅ -1	# 118~118.5	171	CH ₃	H	NH	N=C< 	# 136~138
157		H	S	CH ₃	# 93~95	172	CH ₃	CH ₃	NH	N=C< 	# 243
158		H	S	C ₂ H ₅	n _D ²⁰ 1.6384	173		H	NH	N=C< 	# 177~172.5
159		H	O		m.p. 113~114	174	CH ₃	H	NH	N=CH< 	# 189~190
160		H	S		n _D ²⁰ 1.6426	175	CH ₃	H	NH	NHCOCC ₄ H ₉ -t	# 107~109

- 3 3 -

- 3 4 -

化合物 No.	R ₁	R ₂	R ₃		物性値(沸点 または融解率)
			X	R ₄	
176	CH ₃	CH ₃	NH	NEtOC ₄ H ₉ -t	n. p. 202~204
177	CH ₃	C ₆ H ₁₃ -n	NH	NEtOC ₄ H ₉ -t	# 224~226
178	CH ₃	C ₆ H ₁₃ -n	NH	NEtOC ₄ H ₉ -t	# 173~175
179		H	NH	NEtOC ₄ H ₉ -t	# 1915~1925
180	CH ₃	C ₆ H ₁₃ -n	NH	NHCOCH ₂ CH ₂	# 176~179
181	CH ₃	C ₆ H ₁₃ -n	NH	NHCOCH ₂ CH ₂	# 176~179
182	CH ₃	CH ₃	NH	NH ₂	# 187~190
183	CH ₃	C ₆ H ₁₃ -n	NH	NH ₂	# 153~155
184	CH ₃	C ₆ H ₁₃ -n	NH	NH ₂	# 156~158

本発明の化合物を含有してなる本発明の農薬
薬用殺菌剤を農園農作物の病害防除に使用する
には、本発明の化合物をそのままあるいは水、
固体粉末その他の適当な担体を用いて希釈し必
用に応じて展着剤等の補助剤を加えて使用する
か、または農薬製造に一般的に行なわれている

- 33 -

更に必要ならば他の殺菌剤、殺虫剤、除草剤、
植物生長調節剤、殺線虫剤等の農薬または肥料
等を混合して用いることもできる。

本発明の農園薬用殺菌剤は病害防除が望まれ
る作物に直接散布して用いることができるほか、
必要に応じて水面や土壌表面等の作物の生育環
境に適用することもでき、土壌中に混和して使
用することもできる。本発明の農園薬用殺菌剤
を液剤として使用する場合には通常散布液中に
本発明の化合物が10~1000 ppmの濃度で含ま
れるようにするのが望ましく、濃厚少量散布、
航空機散布等の場合には必要に応じてより濃厚
な散布液として使用することができ、粉剤、粒
剤、微粒剤等として用いる場合には0.1~3.0
%含まれるようにすることが望ましい。

次に本発明の農園薬用殺菌剤の実施例を示す
が、本発明はこれに限定されるものではない。

- 37 -

方法により各種の液体あるいは固体担体と混合
し必要ならば展着剤、展着剤、分散剤、乳化剤、
固着剤等の補助剤を加えて水和剤、液剤、乳剤、
粉剤、粒剤、微粒剤等の種々の製剤形態にして
使用することができる。

これらの製剤を製造するに当つては、液体担
体としては例えば水、芳香族炭化水素類、脂肪
族炭化水素類、アルコール類、エステル類、ケ
トン類、極性の大きなジメチルホルムアミド、
ジメチルスルホキシド等の溶剤、固体担体とし
てはクレー、タルク、カオリン、ベントナイト、
珪藻土、炭酸カルシウム、珪酸等の鉱物質粉末
類、本粉その他の有機質粉末類を用いることが
でき、補助剤としては非イオン、阴イオン、陽
イオンまたは両性の界面活性剤、リグニンス
ルホン酸あるいはその塩、ガム類、脂肪酸塩類、
メチルセルロース等の原料が挙げられる。

- 36 -

実施例 16 水和剤

化合物2の化合物20重量部とポリオキシ
エチレンアルキルアールエーテル5重量部、
リグニンスルホン酸カルシウム3重量部、およ
び珪藻土72重量部を均一に粉砕混合すれば有
効成分20%を含む水和剤を得る。

実施例 17 粒剤

化合物19の化合物5重量部とリグニンス
ルホン酸カルシウム1重量部、ベントナイト30
重量部およびクレー64重量部を均一に粉砕混
合し、次に適量の水を加えて粉合した後、造
粒して乾燥すれば、有効成分5%を含む粒剤を
得る。

実施例 18 粉剤

化合物10の化合物3重量部と無水珪酸
粉末0.5重量部、ステアリン酸カルシウム0.5
重量部、クレー50重量部およびタルク46重

- 38 -

量部を均一に粉砕混合すれば有効成分5%を含む粉剤を得る。

実施例19 乳 剤

化合物1の化合物20重量部とジノナルホルムアミド30重量部、キシレン35重量部およびポリオキシエチレンアルキルアールエーテル15重量部を均一に溶解混合すれば有効成分20%を含む乳剤を得る。

試験例1 水稲のいもち病防除効果試験(予防)

田圃内で直徑9cmの素焼鉢で土耕栽培した水稲(品種:朝日)の第3葉期苗に実施例16に準じて調製した水和剤を所定濃度に希釈した供試薬液を散布した。散布1日後にいもち病菌の担子胞菌液を噴霧接種した。接種後一夜恒温条件下(湿度95~100%、温度24~25℃)に保つた。接種5日後に第3葉の1本あたりの病斑数を調査し、次式により防除価を算出した。

- 49 -

また稲に対する薬害を次記の指標により調査した。結果は第2表のとおりである。

$$\text{防除価} = \left(1 - \frac{\text{散布区の病斑数}}{\text{無散布区の病斑数}} \right) \times 100$$

薬害の調査指標

5: 激 甚

4: 甚

3: 多

2: 若干

1: わずか

0: なし

第2表 (いもち病予防効果)

化合物A	散布濃度 (ppm)	防除価 (%)	薬害程度
1	200	100	0
2	#	100	0
3	#	100	0
4	#	100	0
5	#	100	0

- 40 -

化合物A	散布濃度 (ppm)	防除価 (%)	薬害程度
6	200	100	0
7	#	100	0
8	#	94	0
9	#	100	0
10	#	100	0
11	#	100	0
12	#	100	0
13	#	92	0
14	#	100	0
15	#	100	0
16	#	100	0
17	#	100	0
18	#	100	0
19	#	100	0
20	#	100	0
21	#	100	0
22	#	100	0
23	#	100	0
24	#	100	0
25	#	100	0
26	#	100	0
27	#	100	0
28	#	100	0
29	#	100	0
30	#	100	0
31	#	71	0
32	#	100	0

- 41 -

化合物A	散布濃度 (ppm)	防除価 (%)	薬害程度
33	200	100	0
34	#	100	0
35	#	100	0
36	#	100	0
37	#	100	0
38	#	100	0
39	#	100	0
40	#	100	0
41	#	100	0
42	#	93	0
43	#	93	0
44	#	100	0
45	#	100	0
46	#	100	0
47	#	96	0
48	#	100	0
49	#	73	0
50	#	100	0
51	#	100	0
52	#	100	0
53	#	100	0
54	#	100	0
55	#	100	0
56	#	100	0
57	#	100	0
58	#	100	0
59	#	100	0

- 42 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除率 (%)	薬害程度
60	200	100	0
61	#	100	0
62	#	100	0
63	#	100	0
64	#	93	0
65	#	100	0
66	#	100	0
67	#	100	0
68	#	93	0
69	#	100	0
70	#	100	0
72	#	100	0
73	#	99	0
74	#	100	0
75	#	100	0
76	#	95	0
77	#	99	0
78	#	82	0
79	#	91	0
81	#	100	0
82	#	100	0
84	#	95	0

- 43 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除率 (%)	薬害程度
85	200	83	0
86	#	100	0
87	#	100	0
88	#	85	0
89	#	100	0
91	#	100	0
92	#	100	0
93	#	83	0
94	#	95	0
95	#	82	0
96	#	100	0
97	#	92	0
98	#	86	0
99	#	100	0
100	#	100	0
101	#	100	0
102	#	85	0
103	#	88	0
104	#	100	0
105	#	92	0
106	#	100	0
107	#	100	0

- 44 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除率 (%)	薬害程度
108	200	100	0
109	#	100	0
110	#	100	0
111	#	100	0
112	#	100	0
113	#	85	0
114	#	100	0
115	#	100	0
117	#	100	0
118	#	100	0
119	#	100	0
120	#	100	0
121	#	92	0
122	#	84	0
123	#	100	0
124	#	75	0
125	#	100	0
126	#	100	0
127	#	100	0
128	#	100	0
129	#	100	0
130	#	93	0

- 45 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除率 (%)	薬害程度
131	200	100	0
132	#	100	0
133	#	100	0
134	#	100	0
135	#	100	0
136	#	100	0
137	#	100	0
138	#	100	0
139	#	100	0
140	#	100	0
141	#	100	0
142	#	100	0
143	#	100	0
144	#	100	0
145	#	100	0
146	#	100	0
147	#	86	0
148	#	94	0
149	#	92	0
150	#	100	0
151	#	84	0
152	#	100	0

- 46 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除値 (%)	被害程度	特開 昭54-115384(13)			
				化合物名	散布濃度 (ppm)	防除値 (%)	被害程度
153	200	100	0	176	200	95	0
154	#	82	0	177	#	92	0
155	#	100	0	180	#	85	0
156	#	100	0	181	#	94	0
157	#	100	0	182	#	93	0
158	#	96	0	183	#	100	0
159	#	82	0	184	#	85	0
160	#	100	0	比較薬剤1	#	75	5
161	#	81	0	# 2	#	76	5
162	#	92	0	# 3	#	74	5
163	#	100	0	# 4	480	76	0
164	#	100	0	無処理区	-	0	-
165	#	100	0				
166	#	100	0				
167	#	100	0				
168	#	100	0				
169	#	100	0				
170	#	100	0				
171	#	76	0				
173	#	85	0				
174	#	100	0				
175	#	78	0				

- 47 -

- 48 -

4-メチル-6-チオシアノピリミジンをそれぞれ含有する実施例1に準じて調製した水和剤であり、また比較薬剤4は0,0-ジイソプロピルβ-ベンジルホスホロチオレートを含む市販の殺菌剤(商品名キタジンプ乳剤)である。

試験例2 水稻のいもち病防除効果試験(治癒)

温室内で直径9cmの薬鉢等に土耕栽培した水稻(品種:朝日)の第3葉期前にいもち病菌の胞子懸濁液を噴霧接種した。接種後一昼夜温室条件下(湿度95~100%,温度24~25℃)に保つた。接種1日後に所定濃度に希釈した供試薬液を散布した。散布5日後に試験例1と同様に防除値および被害程度を調査した。結果は第3表のとおりである。

第 3 表 (いもち病防除効果)

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除値 (%)	被害程度
1	200	100	0
2	#	100	0
3	#	100	0
4	#	100	0
5	#	100	0
6	#	100	0
7	#	100	0
8	#	100	0
9	#	100	0
10	#	100	0
11	#	98	0
12	#	100	0
13	#	91	0
17	#	100	0
18	#	100	0
19	#	100	0
20	#	100	0
21	#	78	0
23	#	100	0
25	#	100	0
26	#	100	0

- 49 -

- 50 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除値 (%)	被害程度	化合物名	散布濃度 (ppm)	防除値 (%)	被害程度
27	200	100	0	51	200	88	0
28	#	100	0	52	#	100	0
29	#	100	0	54	#	100	0
30	#	100	0	56	#	100	0
32	#	100	0	57	#	100	0
33	#	100	0	58	#	100	0
34	#	100	0	59	#	100	0
35	#	100	0	60	#	100	0
36	#	100	0	61	#	92	0
37	#	100	0	62	#	100	0
38	#	100	0	63	#	100	0
39	#	87	0	64	#	100	0
40	#	74	0	65	#	100	0
41	#	100	0	66	#	94	0
42	#	100	0	67	#	100	0
43	#	100	0	69	#	82	0
44	#	100	0	70	#	77	0
45	#	100	0	76	#	84	0
46	#	100	0	78	#	79	0
48	#	100	0	79	#	76	0
49	#	90	0	82	#	76	0
50	#	100	0	84	#	76	0

- 51 -

- 52 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除値 (%)	被害程度	化合物名	散布濃度 (ppm)	防除値 (%)	被害程度
88	200	76	0	127	200	100	0
94	#	85	0	128	#	100	0
96	#	86	0	129	#	100	0
97	#	84	0	130	#	100	0
104	#	100	0	131	#	100	0
105	#	100	0	132	#	100	0
106	#	98	0	133	#	94	0
108	#	100	0	134	#	100	0
109	#	91	0	135	#	100	0
110	#	100	0	136	#	86	0
112	#	85	0	137	#	92	0
115	#	84	0	138	#	100	0
117	#	100	0	139	#	100	0
118	#	90	0	140	#	90	0
119	#	93	0	141	#	100	0
120	#	82	0	142	#	95	0
121	#	100	0	143	#	100	0
122	#	95	0	144	#	100	0
123	#	100	0	145	#	100	0
124	#	100	0	146	#	88	0
125	#	99	0	147	#	100	0
126	#	81	0	148	#	94	0

- 53 -

- 54 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除値 (%)	被害程度	化合物名	散布濃度 (ppm)	防除値 (%)	被害程度
149	200	90	0	171	200	96	0
150	#	100	0	172	#	100	0
151	#	99	0	173	#	90	0
152	#	100	0	174	#	100	0
153	#	100	0	175	#	89	0
154	#	100	0	176	#	95	0
155	#	100	0	177	#	94	0
156	#	100	0	178	#	95	0
157	#	100	0	179	#	88	0
158	#	94	0	180	#	100	0
159	#	100	0	181	#	100	0
160	#	92	0	182	#	84	0
161	#	81	0	183	#	87	0
162	#	86	0	184	#	94	0
163	#	100	0	比較薬剤1	#	70	5
164	#	100	0	# 2	#	71	5
165	#	100	0	# 3	#	70	5
166	#	100	0	# 4	480	80	0
167	#	100	0	熱処理区	-	0	-
168	#	100	0				
169	#	100	0				
170	#	97	0				

上記表中、比較薬剤1、2、3および4は試
験例1と同じ薬剤を示す。

- 55 -

- 55 -

試験例3 水稻ごま葉枯病防除効果試験

強室内で直径9cmの素鉢鉢で土耕栽培した水
稻（品種：朝日）の第4葉期苗に所定濃度に
希釈した薬液を散布し、散布1日後に稲ごま葉
枯病菌の分生孢子懸濁液を噴霧接種した。接種
5日後に第4葉の1葉あたりの病斑数を調査し
て次式により防除値を算出した。また試験例1
と同様な方法により稲に対する被害を調査した。
結果は第4表のとおりである。

$$\text{防除値(\%)} = \left(1 - \frac{\text{散布区の病斑数}}{\text{無散布区の病斑数}} \right) \times 100$$

第4表 (ごま葉枯病防除効果)

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除値 (%)	被害程度
1	500	100	0
2	#	100	0
3	#	100	0
4	#	100	0
5	#	100	0
6	500	100	0
7	#	100	0
8	#	92	0
9	#	99	0
10	#	94	0
11	#	100	0
12	#	85	0
13	#	100	0
14	#	100	0
15	#	100	0
16	#	100	0
17	#	100	0
18	#	100	0
19	#	100	0
20	#	100	0
21	#	100	0
22	#	100	0
23	#	100	0
24	#	100	0
25	#	100	0
26	#	100	0
27	#	100	0

- 57 -

- 58 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除価 (%)	薬害程度	化合物名	散布濃度 (ppm)	防除価 (%)	薬害程度
28	500	100	0	56	500	100	0
29	#	100	0	57	#	100	0
30	#	100	0	58	#	100	0
32	#	84	0	59	#	100	0
36	#	100	0	60	#	100	0
37	#	100	0	61	#	94	0
38	#	100	0	62	#	81	0
39	#	100	0	63	#	100	0
40	#	100	0	64	#	100	0
41	#	100	0	65	#	100	0
42	#	84	0	66	#	100	0
44	#	95	0	67	#	100	0
45	#	100	0	69	#	78	0
46	#	100	0	70	#	90	0
47	#	97	0	71	#	95	0
48	#	100	0	74	#	100	0
50	#	100	0	76	#	80	0
51	#	100	0	78	#	91	0
52	#	100	0	81	#	77	0
53	#	61	0	82	#	100	0
54	#	100	0	87	#	100	0
55	#	60	0	88	#	100	0

- 59 -

- 60 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除価 (%)	薬害程度	化合物名	散布濃度 (ppm)	防除価 (%)	薬害程度
89	500	100	0	124	500	100	0
90	#	100	0	125	#	100	0
91	#	87	0	126	#	93	0
94	#	100	0	127	#	87	0
96	#	84	0	128	#	78	0
97	#	89	0	129	#	100	0
104	#	100	0	130	#	86	0
105	#	100	0	131	#	81	0
106	#	100	0	132	#	93	0
107	#	100	0	133	#	95	0
108	#	100	0	134	#	100	0
109	#	100	0	135	#	100	0
110	#	87	0	136	#	94	0
111	#	86	0	137	#	91	0
112	#	82	0	138	#	100	0
117	#	100	0	139	#	78	0
118	#	84	0	140	#	93	0
119	#	76	0	141	#	100	0
120	#	82	0	142	#	90	0
121	#	98	0	143	#	84	0
122	#	92	0	144	#	100	0
125	#	100	0	145	#	87	0

- 61 -

- 62 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除値 (%)	被害程度
146	500	100	0
147	#	100	0
148	#	94	0
149	#	88	0
150	#	85	0
151	#	99	0
152	#	90	0
153	#	100	0
154	#	100	0
155	#	100	0
156	#	100	0
157	#	100	0
158	#	93	0
159	#	98	0
160	#	90	0
161	#	77	0
162	#	75	0
163	#	100	0
164	#	100	0
165	#	100	0
166	#	100	0
167	#	100	0

- 65 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除値 (%)	被害程度
168	500	100	0
169	#	100	0
170	#	100	0
171	#	100	0
172	#	100	0
173	#	100	0
174	#	83	0
176	#	76	0
177	#	76	0
180	#	89	0
181	#	100	0
182	#	93	0
183	#	90	0
184	#	86	0
比較薬剤 1	#	75	5
# 2	#	73	5
# 3	#	70	5
# 4	#	90	0
無処理区	—	0	—

上記表中、比較薬剤 1、2 および 3 は試験例 1 に同じであり、そして比較薬剤 4 は 2,4-D

- 64 -

クロロ-6-(0-クロロアニリノ)-1,3,5-トリアジンを含有する市販の殺菌剤(一般名トリアジン)である。

試験例 4 ヤムウリうどんと病防除効果試験

温室内で直径 9cm の紫施設鉢に土耕栽培したヤムウリ(品種:相模半白)の第 1 葉期苗に所定濃度に希釈した薬液を 10 ml 宛散布し、一夜放置後うどんと病菌孢子懸濁液を噴霧接種した。接種 10 日後に病斑面積歩合を調査し、下記式により防除値を算出した。また試験例 1 に準じてヤムウリに対する薬害を調査した。結果は第 5 表のとおりである。

$$\text{防除値}(\%) = \left(1 - \frac{\text{散布区の病斑面積歩合}}{\text{無散布区の病斑面積歩合}} \right) \times 100$$

- 65 -

第 5 表 (うどんと病防除効果)

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除値 (%)	被害程度
1	200	100	0
2	#	100	0
3	#	100	0
4	#	100	0
5	#	100	0
6	#	100	0
7	#	100	0
8	#	92	0
9	#	90	0
10	#	88	0
11	#	94	0
12	#	90	0
13	#	100	0
14	#	100	0
15	#	95	0
16	#	86	0
18	#	77	0
19	#	91	0
20	#	84	0
21	#	73	0
22	#	79	0

- 66 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除率 (%)	被害程度
2.3	200	81	0
2.5	#	74	0
2.6	#	80	0
3.0	#	80	0
3.1	#	75	0
3.2	#	75	0
3.6	#	75	0
3.7	#	75	0
4.1	#	75	0
4.2	#	77	0
4.3	#	93	0
5.0	#	85	0
5.1	#	100	0
5.2	#	100	0
5.3	#	78	0
5.4	#	100	0
5.6	#	90	0
5.7	#	100	0
5.8	#	100	0
5.9	#	80	0
6.0	#	96	0
6.1	#	100	0

- 67 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除率 (%)	被害程度
6.2	200	91	0
6.4	#	77	0
6.5	#	100	0
6.6	#	100	0
6.7	#	100	0
6.9	#	75	0
7.1	#	75	0
7.6	#	75	0
7.8	#	78	0
8.1	#	86	0
8.7	#	75	0
9.2	#	75	0
9.3	#	74	0
9.4	#	79	0
9.5	#	81	0
9.6	#	82	0
9.7	#	80	0
9.8	#	75	0
9.9	#	78	0
10.1	#	68	0
10.2	#	65	0
10.3	#	75	0

- 68 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除率 (%)	被害程度
10.6	200	100	0
10.7	#	100	0
10.8	#	100	0
10.9	#	96	0
11.0	#	92	0
11.1	#	89	0
11.2	#	100	0
11.3	#	94	0
11.4	#	86	0
11.5	#	77	0
11.6	#	65	0
11.7	#	100	0
11.8	#	100	0
11.9	#	93	0
12.0	#	94	0
12.1	#	100	0
12.2	#	100	0
12.3	#	100	0
12.4	#	100	0
12.5	#	93	0
12.6	#	100	0
12.7	#	100	0

- 69 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除率 (%)	被害程度
12.8	200	100	0
12.9	#	100	0
13.0	#	77	0
13.1	#	97	0
13.2	#	100	0
13.3	#	100	0
13.4	#	94	0
13.5	#	92	0
13.6	#	82	0
13.7	#	94	0
13.8	#	100	0
13.9	#	92	0
14.0	#	99	0
14.1	#	100	0
14.2	#	96	0
14.3	#	95	0
14.4	#	100	0
14.5	#	91	0
14.6	#	100	0
14.7	#	83	0
14.8	#	90	0
14.9	#	91	0

- 70 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除率 (%)	被害程度
150	200	88	0
151	#	85	0
152	#	79	0
153	#	100	0
154	#	100	0
155	#	100	0
156	#	100	0
157	#	100	0
158	#	95	0
159	#	87	0
160	#	80	0
163	#	100	0
164	#	100	0
165	#	100	0
166	#	100	0
167	#	100	0
168	#	100	0
169	#	100	0
170	#	98	0
171	#	92	0
172	#	94	0
173	#	99	0

- 71 -

化合物名	散布濃度 (ppm)	防除率 (%)	被害程度
174	200	100	0
175	#	82	0
176	#	84	0
177	#	78	0
178	#	76	0
179	#	92	0
180	#	94	0
181	#	95	0
182	#	81	0
183	#	79	0
184	#	84	0
比較薬剤 1	#	53.2	1
# 2	#	48.3	1
# 3	#	95.8	0
無処理区	-	0	-

- 72 -

含有する成分（ミルカーブ剤）である。

第1頁の続き

特許出願人 北興化学工業株式会社

④発明者 松本邦臣
町田市成瀬2712-80同 渡辺哲郎
横浜市神奈川区松見町二丁目39
0番地の3

同 明治製菓株式会社

④出願人 明治製菓株式会社
東京都中央区京橋二丁目4番16
号

代理人 弁護士 山下 白

手続補正書

昭和53年4月27日

特許庁長官 熊谷 善二 殿

1. 事件の表示

昭和53年特許願第 23413 号

2. 発明の名称 ビラゾリルピリミジン誘導体および
農薬用殺菌剤

3. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

住所 東京都中央区日本橋本石町4丁目2番地

名称 北興化学工業株式会社

4. 代理人

住 所 東京都千代田区麹町3丁目2番地（相互第一ビル）

電話 (361) 2022

氏名 (6256) 山下 白

5. 補正命令の日付（自発）

昭和53年4月27日

6. 補正の対象

明細書の発明の詳細な説明の欄



手続補正書

昭和53年6月22日

特許庁長官 熊谷 善二 殿

1. 事件の表示

昭和53年特許願第 23413 号

2. 発明の名称 ビラゾリルピリミジン誘導体および
農薬用殺菌剤

3. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

住所 東京都中央区日本橋本石町4丁目2番地

名称 北興化学工業株式会社

4. 代理人

住 所 東京都千代田区麹町3丁目2番地（相互第一ビル）

電話 (361) 2022

氏名 (6256) 山下 白

5. 補正命令の日付（自発）

昭和53年4月27日

6. 補正の対象

明細書の発明の詳細な説明の欄



7. 補正の内容

特開昭54-11538(20)

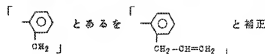
1) 第12頁第1行において「底166」とあるを「底166」と補正します。

2) 第12頁第4行において「ヒドロキシフェニルピリミジン」とあるを「ヒドロキシピリミジン」と補正します。

3) 第12頁第7行において「底166」とあるを「底166」と補正します。

4) 第22頁において底6の化合物の物性値「159~140.5」とあるを「159~140.5」と補正します。

5) 第22頁において底64の化合物の構造式






します。

以上








- 2 -

7. 補正の内容

1) 第35頁下から第7行と第6行との間に次の記載を加えます。

185	H	NH	NH ₂	n.p. 181~183
186	H	H	NH N=CHCH ₃	n _D ²⁰ 1.5582
187	H	NH	N=CHCH ₃	n.p. 60~62
188	CH ₃	H	NH N=CHCH ₃	n _D ²⁰ 1.5840
189	CH ₃	H	NH N=CHCH ₃	n.p. 61~62.5
190	CH ₃	H	NH N=CHCH ₃	n _D ²⁰ 1.5822
191	CH ₃	H	NH N=CH- 	n.p. 185~186
192	CH ₃	H	NH N=CH- 	n 150~151
193	CH ₃	H	NH N=CH- 	n 156.5~158
194	H	CH ₃	NH NH ₂	n 112~114
195	H	CH ₃	NH N=CHCH ₃	n _D ²⁰ 1.5594
196	H	CH ₃	NH N=CHCH ₃	n.p. 91~94
197	CH ₃	CH ₃	NH N=CHCH ₃	n 176~178

- 2 -

198	CH ₃	CH ₃	NH	N=CH- 	w.p. 152~154	185	200	特別期54-115384(21)	80	0
199	CH ₃	CH ₃	NH	N=O- 	# 145~146	187	#		75	0
200	CH ₃	n-C ₄ H ₉	NH	NH ₂	# 107~108.5	188	#		80	0
201	CH ₃	n-C ₄ H ₉	NH	N=CHCH ₃	n _D ²⁵ 1.5603	190	#		90	0
202	CH ₃	n-C ₄ H ₉	NH	N=CHCH ₂ -n	# 1.5555	192	#		98	0
203	CH ₃	n-C ₄ H ₉	NH	N=O- 	w.p. 52~54	193	#		80	0
204	n-C ₆ H ₁₃	H	NH	NH ₂	# 119~120	194	#		75	0
205	n-C ₆ H ₁₃	H	NH	N=CHCH ₃	# 57~60	195	#		75	0
206	n-C ₆ H ₁₃	H	NH	N=O- 	# 67~69	200	#		90	0
207	n-C ₆ H ₁₃	H	NH	N=O- 	n _D ²⁵ 1.5744	201	#		99	0
208		H	NH	N=CH ₂	w.p. 80~83.5	202	#		80	0
209		H	NH	N=CHCH ₃	# 98~101	203	#		95	0
2) 第48頁第8行と第9行との間に次の記載						204	#		100	0
を加入します。						205	#		100	0
						206	#		100	0
						207	#		92	0
						208	#		75	0
						209	#		80	0

- 3 -

- 4 -

3) 第56頁下から第8行と第7行との間に次の記載を加入します。	188	500	100	0	189	#	100	0
					190	#	100	0
「	185	200	75	0	191	#	100	0
	186	#	80	0	192	#	100	0
	187	#	75	0	193	#	100	0
	189	#	80	0	194	#	100	0
	191	#	85	0	195	#	100	0
	192	#	75	0	196	#	100	0
	193	#	75	0	197	#	100	0
	194	#	80	0	198	#	85	0
	195	#	75	0	199	#	92	0
	207	#	85	0	200	#	100	0
	209	#	85	0	201	#	100	0
					202	#	100	0
					203	#	100	0
					204	#	100	0
4) 第64頁下から第8行と第7行との間に次の記載を加入します。	205	#	100	0	206	#	100	0
					207	#	100	0
「	185	500	100	0	208	#	80	0
	186	#	100	0	209	#	100	0
	187	#	100	0				

- 5 -

- 6 -

5) 第 7 2 頁第 1 2 行と第 1 3 行との間に次の

特開昭54-115384(22)

記載を加入します。

「	188	200	85	0
	191	"	80	0
	192	"	90	0
	193	"	96	0
	200	"	75	0
	201	"	100	0
	202	"	86	0
	203	"	96	0
	205	"	87	0
	206	"	88	0
	209	"	78	0
				」

以 上

— 7 —